

## ⑫ 公開特許公報(A)

昭61-87695

⑬ Int. Cl.<sup>4</sup> 識別記号 庁内整理番号 ⑭ 公開 昭和61年(1986)5月6日  
 C 07 K 7/20 6464-4H  
 A 61 K 37/24 7138-4C  
 // C 07 K 99:54 6464-4H 審査請求 未請求 発明の数 1 (全13頁)

⑮ 発明の名称 GnRH拮抗物質

⑯ 特 願 昭60-197532

⑰ 出 願 昭60(1985)9月6日

優先権主張 ⑱ 1984年9月7日 ⑲ 米国(US) ⑳ 648637

㉑ 発 明 者 ワイリー・ウォーカ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, バ  
ー・ベール・ジュニア ルデズ 1643

㉒ 発 明 者 ジャン・エドワール・ アメリカ合衆国カリフォルニア州92037, ラ・ホーラ, プ  
フレデリック・リベ ラックゴールド・ロード 9674  
ル

㉓ 出 願 人 ザ・サルク・インステ アメリカ合衆国カリフォルニア州ラ・ホーラ, ノース・ト  
チュート・フォー・バ ーレイ・バインズ・ロード 10010  
イオロジカル・スタデ  
ーズ

㉔ 代 理 人 弁理士 湯浅 恭三 外5名

## 明 細 書

## 1. [ 発 明 の 名 称 ]

GnRH 拮 抗 物 質

## 2. [ 特 許 請 求 の 範 囲 ]

## (1) 次 式 :

$X-R_1-(W)D-Phe-R_2-R_3-R_4-R_5-R_6(V)-R_7-$   
 $Arg-Pro-R_{10}$

[ 式中、Xは水素原子または7個以下の炭素原子  
 を有するアシル基であり；

$R_1$ はデヒドロ-Pro, Pro, D-pGlu, D-Phe,  
 D-Trp または  $\beta$ -D-NAL であり；

WはF, Cl,  $Cl_2$ , Br,  $NO_2$  または  $C^aMe-Cl$   
 であり；

$R_2$ はD-Trp, ( $N^{in}For$ )D-Trp または  $NO_2$ ,  
 $NH_2$ ,  $OCH_3$ , F, Cl, Br または  $CH_3$  で5位また  
 は6位が置換されたD-Trp であり；

$R_3$ はSer, Orn, AAL または  $nBu$  であり；

$R_4$ はTyr, (3F)Phe, (2F)Phe, (3I)Tyr,  
 (3CH<sub>3</sub>)Phe, (2CH<sub>3</sub>)Phe, (3Cl)Phe または  
 (2Cl)Phe であり；

$R_5$ はD-Lys, D-Orn または D-Dap であり；

Vは  $(arg-R^1, R^2)_n(X)$  であり、ただしnは  
 1~5であり、 $R^1$ および $R^2$ はH、メチル、エチ  
 ル、プロピルまたはブチルであり；

$R_7$ はLeu, NML, Nle または Nva であり；

そして

$R_{10}$ はGly-NH<sub>2</sub>, D-Ala-NH<sub>2</sub> または NH-Y  
 であり、ただしYは低級アルキル、シクロアルキ  
 ル、フルオル低級アルキルまたはNH-CONH-Q  
 (ここでQはHまたは低級アルキルである)であ  
 る]

で表わされるペプチドまたはその無塩性塩。

(2)  $R_3$ が(6NO<sub>2</sub>)D-Trp であり、 $R_6$ がD-Lys  
 である特許請求の範囲第1項記載のペプチド。

(3)  $R_1$ が $\beta$ -D-2NAL である特許請求の範囲第  
 1項または第2項記載のペプチド。

(4) VがArg<sub>3</sub>(Ac) である特許請求の範囲第1~  
 3項のいずれか1つに記載のペプチド。

(5) XがAc である特許請求の範囲第1~4項の  
 いずれか1つに記載のペプチド。